

## 特 許 公 報

昭35-8315

公 告 昭 35.7.1 出 願 昭 32.8.20 特 願 昭 32-20524

発 明 者 於 勢 真 輔 宝塚市宝塚字武庫山 85

同 高 松 秀 二 尼崎市塚口 926

出 願 人 大 日 本 製 薬 株 式 会 社 大阪市東区道修町 3 の 25

(全 2 頁)

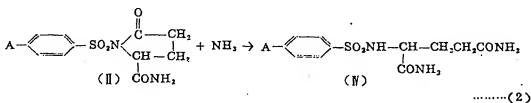
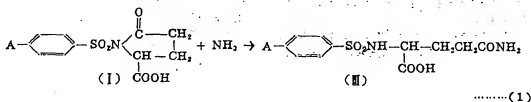
P 位にアミノ基に変じ得る基を有するベンゼンスルホニ  
ルグルタミン酸アミド類の製造法

## 発明の詳細な説明

本発明は P 位にアミノ基に変じ得る基を有するベンゼンスルホンイル-2-ビロリド-5-カルボン酸又はその酸アミドにアンモニアを用せしめることによりなる P 位にアミノ基に変じ得る基を有するベンゼンスルホンイルグルタミン酸アミド類の製造法に係る。

即ち、次の化学反応式に示すように、P 位にアミノ基に

変じ得る基を有するベンゼンスルホンイル-2-ビロリド-5-カルボン酸(Ⅰ)にアンモニアを用せしめて N-置換グルタミン(Ⅱ)となす(1)式の反応及び P 位にアミノ基に変じ得る基を有するベンゼンスルホンイル-2-ビロリド-5-カルボン酸アミド(Ⅲ)にアンモニアを用せしめて N-置換グルタミド(Ⅳ)となす(2)式の反応が含まれる。



(式中、A はアミノ基に変じ得る基例えばニトロ基、アシルアミノ基等の如き基を示す)

上に於て(1)式で示される反応は、アンモニア水と共に加熱することによつて進められ、次に酸性となすことによつて目的物を析出せしめる。又、(2)式で示される反応はアンモニア水と共に加熱することによつて進められる。而して(1)式及び(2)式で示される反応によつて得られる粗製品は、稀アルコールより再結晶することによつて精製される。

本発明方法によつて得られる化合物は、いずれも抗ウイルス性を有し、又抗ウイルス性化学療法剤製造の中間体として重要なものである。

次に実施例をあげて説明する。

## 実施例 1

N-(P-ニトロベンゼンスルホンイル)-グルタミンの製法

N-(P-ニトロベンゼンスルホンイル)-2-ビロリド-5-カルボン酸5gを過アンモニア水20ccに溶解し、水浴上で30分間加熱し、冷後塩酸性となし、析出する結晶をアルコールより再結晶すれば N-(P-ニトロベンゼンスルホンイル)-グルタミン 4g が得られる。融点 174~175℃。

分析:  $\text{C}_{11}\text{H}_{13}\text{O}_7\text{N}_3\text{S}$

	C	H	N	S
計算値	39.9 %	3.96%	12.68%	9.68%
実験値	40.29%	4.15%	12.49%	9.49%

## 実施例 2

N-(P-ニトロベンゼンスルホンイル)-グルタミドの製法

N-(P-ニトロベンゼンスルホンイル)-2-ビロリド-5-カルボン酸アミド 3g に過アンモニア水 20cc とアルコール 15cc を加え水浴上で加熱する。暫時後アルコールの大部分を溜去し、残液を稀アルコールより再結晶すれば N-(P-ニトロベンゼンスルホンイル)-グルタミド 2.6g が得られる。融点 206℃(分解)。

分析:  $\text{C}_{11}\text{H}_{13}\text{O}_8\text{N}_3\text{S}$

	C	H	N
計算値	40.00%	4.27%	16.97%
実験値	39.86%	4.35%	16.77%

## 実施例 3

N-(P-アセチルアミノベンゼンスルホンイル)-グルタミンの製法

N-(P-アセチルアミノベンゼンスルホン)-2-ビロリドン-5-カルボン酸を実施例(1)の方法と全く同様に処理することによつて得られる。融点178~179℃(アルコールより再結晶)。

分析:  $C_{15}H_{11}O_6N_2S$

	C	H	N	S
計算値	45.48%	4.99%	12.24%	9.34%
実験値	45.53%	5.00%	12.02%	9.41%

前記方法と全く同様にして

N-(P-デカノイルアミノベンゼンスルホン)-グルタミン(融点175~177℃)。

N-(P-ドデカノイルアミノベンゼンスルホン)-グルタミン(融点177~178℃)。

N-(P-テトラデカノイルアミノベンゼンスルホン)-グルタミン(融点176~177℃)。

が得られる。

実施例 4

N-(P-アセチルアミノベンゼンスルホン)-グルタミドの製法

N-(P-アセチルアミノベンゼンスルホン)-2-ビロリドン-5-カルボン酸アミドを実施例2の方法と全く

同様に処理することによつて得られる。融点244℃(水より再結晶)。

分析:  $C_{15}H_{11}O_6N_2S$

	C	H	N	S
計算値	45.61%	5.30%	16.37%	9.36%
実験値	45.59%	5.36%	16.13%	9.14%

前記方法と全く同様にして

N-(P-デカノイルアミノベンゼンスルホン)-グルタミド(融点208~209℃)。

N-(P-ドデカノイルアミノベンゼンスルホン)-グルタミド(融点208~209℃)。

N-(P-テトラデカノイルアミノベンゼンスルホン)-グルタミド(融点208~209℃)。

が得られる。

#### 特 許 請 求 の 範 囲

P位にアミノ基に変われる基を有するベンゼンスルホン-2-ビロリドン-5-カルボン酸又はその酸アミドにアンモニアを作用せしめることを特徴とするP位にアミノ基に変われる基を有するベンゼンスルホン-グルタミン酸アミド類の製造法。